

J3678 (SET)

D3

German OLS 199 62 369 A1

Beiersdorf AG

Cosmetic or dermatological preparations containing catechins or green-tea extract and ascorbic acid

Active agent combinations of

- (a) Extracts of the leaves of plants of the order Theales and family Theaceae, particularly of the species *Camellia*, more particularly the tea varieties *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* and *C. irrawadiensis* and hybrids thereof with for example *Camellia japonica* and/or
- (b) Catechins and/or
- (c) Gallic acid esters of catechins and
- (d) one or more ascorbyl compounds, in particular one or more water-soluble ascorbyl compounds, in particular ascorbic acid.

Description

This invention relates to cosmetic or dermatological preparations containing active agents that care for and protect the skin, in particular sensitive and dry skin and more particularly and primarily skin that has been aged or is being aged by intrinsic and/or extrinsic factors, and to the use of such active agents and combinations of these active agents in the field of cosmetic and dermatological skin care.

Cosmetic skin-care is understood to mean primarily an enhancement or restoration of the natural function of the skin as a barrier against environmental influences (for example soiling, chemicals, microorganisms) and against the loss of substances naturally present in the body (e.g. water, natural lipids, electrolytes).

Impairment of this function can result in an increased absorption of toxic or allergenic substances or infection with microorganisms, and hence in toxic or allergic skin reactions.

Skin care also aims to compensate for the loss of lipids and water from the skin caused by daily washing. This is particularly important if the skin's natural regeneration capacity is inadequate. In addition, skin-care products are designed to protect against environmental factors, in particular sun and wind, and to delay skin ageing.

The stratum corneum of the skin is characterised by a special structure which on the one hand protects the skin against loss of vital cellular water and against the ingress of external noxious factors, and on the other stabilises its own elasticity by binding a defined quantity of water: intercellular lipids consisting of free sterols and fatty acids and various classes of ceramides create a barrier inside the stratum corneum in the form of extracellular multilamellar and water-imperious membrane systems.

The lipid membranes surround dead corneocytes with hygroscopic substances. The stratum corneum is constantly undergoing a renewal process, with fine scales (corneocytes with lipids attached to them) continuously moving outwards and new cornified cell and lipid material produced from within. When it is in equilibrium, the regeneration process therefore causes no change in transepidermal water loss.

After a simple bath in water with no added surfactants, the stratum corneum swells, the degree of swelling depending for example on the duration of the bath and its temperature. At the same time, water-soluble substances, e.g. water-soluble soil components as well as substances that occur naturally in the skin and are responsible for the water-binding capacity of the stratum corneum, are washed off or out. Surface-active substances that occur naturally in the skin also dissolve and remove skin lipids to some extent. After the initial swelling, this causes a marked drying of the skin which can be accentuated even further by detergent additives.

With healthy skin, these processes are generally unimportant because the protective mechanisms of the skin can easily compensate for these minor disturbances in its upper layers. But even non-pathological deviations from normality, for example due to environmentally-induced wear or irritation, light damage, aged skin and the like, impair the

protective mechanism of the skin surface. In some cases, the protective mechanism is no longer inherently able to fulfil its function and must be regenerated by external intervention.

It is also known that the composition and quantity of lipids in the stratum corneum of pathologically-changed dry skin, and dry but non-pathological skin of young and older persons differ from the normal condition of healthy, normally-hydrated skin of people in the same age group. The changes in the lipid pattern of the very dry non-eczematous skin of patients with atopic eczema are an extreme case of the differences that are found in dry healthy skin.

These differences affect in particular the ceramides, which are greatly reduced in quantity and whose composition is also different. Particularly noticeable is the deficiency of ceramides 1 and 3; ceramide 1 in particular is known to increase the ordering of lipids in intercellular membrane systems.

The detrimental changes in the lipid membranes may be due to defective lipid biosynthesis and in the end they also increase transepidermal water loss. A long-standing weakness in the barrier makes healthy skin more vulnerable and in some cases it can contribute to eczematous processes developing in unhealthy skin.

The effect of ointments and creams on the barrier function and hydration of the stratum corneum is not generally based on a restoration or reinforcement of the physicochemical properties of the intercellular lipid lamellae. A substantial part of their effect is obtained simply by covering the areas of the skin that are treated and retaining water in the stratum corneum lying underneath. Co-applied hygroscopic substances bind water, resulting in a measurable increase in the water content of the stratum corneum. However, this purely physical barrier can be removed again relatively easily. When product use is discontinued, the skin very quickly returns to its condition prior to the start of treatment. Also, the skin-care effect can diminish with regular use, with the skin returning to its initial condition even while it is being treated. With some products, the condition of the skin worsens temporarily after

their use has stopped. As a rule, a lasting effect is not achieved, or is achieved to only a limited extent.

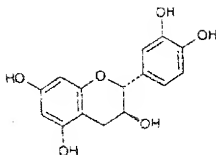
In order to support deficient skin in its natural regeneration and to enhance its physiological function, blends of intercellular lipids have recently been added to topical preparations, the intention being that the skin should use them to restore its natural barrier. However, these lipids and in particular ceramides, are very expensive materials. Also, they are usually much less effective than hoped for.

Accordingly therefore, it was the aim of the present invention to find a way of avoiding the disadvantages of the art. In particular, skin-care products were to have a physiological, rapid and lasting effect.

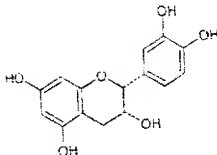
These aims are achieved by the invention. The invention further relates to the use of catechins or the gallic acid esters of catechins, or aqueous or organic extracts of plants or plant parts that contain catechins or the gallic acid esters of catechins, for example the leaves of the plant family Theaceae, in particular the species *Camellia sinensis* (green tea) or its typical constituents (such as for example polyphenols or catechins, caffeine, vitamins, sugars, minerals, amino acids, lipids) for the prophylaxis, treatment and/or care of dry skin conditions.

The catechins are a group of compounds which can be described as hydrogenated flavones or anthocyanidines. Catechins are the basis for a number of natural oligomeric or polymeric tannins for example in tea. They occur together with other phenols in many fruit species and they are involved in the phenoloxidase-catalysed browning that occurs around bruises and cuts (e.g. in apples).

The parent compound, "catechin" (catechol, 3,3',4',5,7-flavanpentol; 2-(3,4-dihydroxyphenyl)-chroman-3,5,7-triol) occurs widely in plants and is found for example in catechu. Its structural formula is as follows:



Epigallocatechin (2R,3R)-3,3',4',5,7-favanpentol) is an epimer of catechin and has the structural formula:



The aims of the invention are also achieved by cosmetic or dermatological preparations that contain plant extracts that have a content of catechins, in particular preparations that contain green-tea extracts.

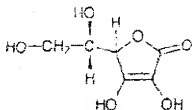
Tea consists exclusively of the leaves, leaf buds and soft stems of the tea bush (*Camellia sinensis* L.) that are prepared by processes such as withering, rolling, fermenting, size reduction and drying. Black tea is a fermented tea, Oolong tea is a partially fermented tea, with leaves that are fermented for only half the usual time after withering and rolling, and then dried. Green tea is an unfermented product whose leaves are blanched, rolled and dried with retention of the natural leaf colour.

The composition of the constituents of tea leaves varies considerably, depending on the origin of the tea and its processing. On average, black tea contains 18.9% catechins and catechin tannins, 16.6% of proteins, 2.7% caffeine, 10.2% other nitrogen compounds, 4.6% oligosaccharides, 0.6% starch, 11.9% pectin, 7.9% cellulose and 6.1% lignin. Fresh leaves have essentially the same composition but contain more catechins (26%), fewer nitrogen compounds (8.7%, but with the same caffeine content), and 0.8% inositol. The polyphenolic tannins contain about 80% of catechins (main component galloyl-(-)-epigallocatechin).

Catechins or the gallic acid esters of catechins, or aqueous or organic extracts of plants or plant parts that contain catechins or the gallic acid esters of catechins, for example leaves of the Theaceae, in particular the species *Camellia sinensis* (green tea), have the disadvantage that their storage stability is very limited. These substances degenerate after a time that is unacceptably short for cosmetic or dermatological preparations, so that their physiological effectiveness is rapidly reduced or completely lost.

Consequently, there was a need to remedy this disadvantage.

The use of ascorbic acid in cosmetics and dermatological preparations is known per se. L-ascorbic acid {(R)-5-[(S)-1,2-dihydroxyethyl]-3,4-dihydroxy-5-H-furan-2-one, vitamin C} has the structural formula

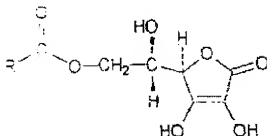


It is readily soluble in water, soluble in alcohol, insoluble in ether, petroleum ether, chloroform, benzene and in oils and fats. Ascorbic acid is an enediol and has a strongly reducing action. Ascorbic acid is sensitive to heat and it is decomposed by light and

atmospheric oxygen particularly in the presence of trace heavy metals and in alkaline medium; however, in the pure dry state it is relatively resistant to light, air and heat.

In cosmetic and dermatological preparations, ascorbyl compounds are often used instead of ascorbic acid, preferably the ascorbyl esters of fatty acids and more preferably ascorbyl palmitate, because these compounds are far less sensitive to oxidation than ascorbic acid and because they are usually more soluble in oils, which can have galenical advantages.

Ascorbyl compounds in the narrower sense are in particular ascorbyl esters having the general structure:



wherein R can be a branched or unbranched alkyl residue with up to 25 carbon atoms.

It has been found surprisingly that active agents combinations comprising

- (a) Extracts of the leaves of plants of the order Theales and family Theaceae, in particular the Camellia species, more particularly the tea varieties *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* and *C. irrawadiensis* and hybrids thereof with for example *Camellia japonica*, and/or
 - (b) Catechins and/or
 - (c) Gallic acid esters of catechins and
 - (d) One or more ascorbyl compounds, in particular one or more water-soluble ascorbyl compounds, in particular ascorbic acid
- achieve the aims according to the invention.

The invention also relates to the use of

(d) one or more ascorbyl compounds, in particular one or more water-soluble ascorbyl compounds, in particular ascorbic acid

to stabilise or improve the storage stability of

(a) Extracts of the leaves of plants of the order Theales and family Theaceae, in particular the *Camellia* species, more particularly the tea varieties *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C.*

taliensis and *C. irrawadiensis* and hybrids thereof with for example *Camellia japonica*, and/or

(b) Catechins and/or

(c) Gallic acid esters of catechins.

The invention preferably finds its application in cosmetic or dermatological preparations, in particular skin-care products.

Advantageously, the preparations of the invention contain from 0.0001 to 20% by weight of catechins or the gallic acid esters of catechins, or aqueous or organic extracts of plants of plant parts that contain catechins or gallic acid esters of catechins, preferably polyphenols or catechins in the group comprising (-)-catechin, (+)-catechin, (-)-catechin gallate, (-)-gallocatechin gallate, (+)-epicatechin, (-)-epicatechin, (-)-epicatechin gallate, (-)-epigallocatechin, (-)-epigallocatechin gallate.

Preferably, the cosmetic or dermatological preparations in accordance with the invention contain from 0.001 to 10% by weight of catechins or gallic acid esters of catechins, or aqueous or organic extracts of plants or plant parts that contain catechins or gallic acid esters of catechins, calculated on the total composition of the preparations.

Especially preferably, cosmetic or dermatological preparations in accordance with the invention contain from 0.01 to 1% by weight of catechins or gallic acid esters of catechins, or aqueous or organic extracts of plants or plant parts that contain catechins or gallic acid esters of catechins, calculated on the total composition of the preparations.

The ascorbyl compound or compounds, in particular vitamin C and/or derivatives such as for example ascorbyl palmitate, Mg ascorbyl phosphate, ascorbyl acetate, is/are advantageously contained in cosmetic or dermatological preparations preferably in amounts from 0.001% by weight to 10% by weight, preferably from 0.05% by weight to 5% by weight and more preferably from 0.1 to 2.0% by weight, calculated on the total composition of the preparations.

Topical preparations in accordance with the invention can be formulated as liquid, pasty or solid preparations, for example as aqueous or alcoholic solutions, aqueous suspensions, emulsions, ointments, creams, gels, oils, powders, or sticks. Depending on the desired formulation, active agents can be incorporated into pharmaceutical and cosmetic bases for topical application, containing as further components for example oils, fats and waxes, emulsifiers, anionic, cationic, ampholytic, zwitterionic and/or nonionic surfactants, lower monohydric or polyhydric alcohols, water, preservatives, buffers, thickeners, perfumes, dyes and opacifiers. Advantageously, the active agents in accordance with the invention can be used in transdermal therapeutic systems, in particular in cubic *[sic]* systems.

It is advantageous to add additives to the topical care preparations, such as vitamins, coenzymes, substrates and co-factors of lipid metabolism or energy metabolism, or other cosmetic or dermatological adjuncts or actives, for example pyridoxine, pyridoxal, pyridoxamine, uridine, L-serine, weak carboxylic acids with pK_a between 3 and 5.5 (e.g. lactic acid and propionic acid), citric acid, pyruvate, as well as cellular energy transfer agents (e.g. creatine, guanine, guanosine, adenine, adenosine, nicotine, nicotinamide, riboflavin), co-enzymes (e.g. coenzyme Q_{10} , pantothenic acid, panthenol, lipoic acid), co-factors (e.g. L-carnitine), substrates (e.g. hexoses, pentoses, fatty acids), taurocholic acid, lipids (e.g. ceramides, cholesterol, fatty acids, sphingosine, sphingomyelin, glucocerebrosides), substrates (e.g. hexoses, pentoses, fatty acids), glutathione and/or natural moisturizing factors (e.g. amino acids, urea, pyrrolidonecarboxylic acid, glycerol).

It is also an advantage to add antioxidants to the preparations of the invention.

Advantageously, the antioxidants are selected from the group comprising amino acids (e.g.

glycine, histidine, tyrosine, tryptophan) and their derivatives, imidazoles (e.g. urocaninic acid) and their derivatives, peptides such as D,L-carnosine, D-carnosine, L-carnosine and their derivatives (e.g. anserine), carotenoids, carotenes (e.g. α -carotene, β -carotene, lycopene) and their derivatives, chlorogenic acid and its derivatives, lipoic acid and its derivatives (e.g. dihydrolipoic acid), aurothioglucoase, propylthiouracil and other thiols (e.g. thioredoxin, glutathione, cysteine, cystine, cystamine and the glycosyl, N-acetyl, methyl, ethyl, propyl, amyl, butyl and lauryl, palmitoyl, oleyl, γ -linoleyl, cholesteryl and glyceryl esters thereof), as well as their salts, dilaurylthiodipropionate, distearylthiodipropionate, thiodipropionic acid and derivatives thereof (esters, ethers, peptides, lipids, nucleotides, nucleosides and salts) as well as sulphoximine compounds (e.g. buthionine sulphoximines, homocysteine sulphoximine, buthionine sulphones, penta-, hexa-, hepta-thionine sulphoximine) in very small tolerated doses (e.g. pmol to μ mol/kg), as well as (metal) chelating agents (e.g. α -hydroxy fatty acids, palmitic acid, phytic acid, lactoferrin), α -hydroxy acids (citric acid, lactic acid, malic acid) humic acid, gallic acid, gall extracts, bilirubin, biliverdin, EDTA, EGTA and derivatives thereof, unsaturated fatty acids and their derivatives (e.g. γ -linolenic acid, linoleic acid, oleic acid), folic acid and its derivatives, ubiquinone and ubiquinol and derivatives thereof, tocopherols and derivatives (e.g. vitamin E acetate), vitamin A and derivatives (vitamin A palmitate) as well as benzoin resin coniferyl benzoate, rutinic acid and its derivatives,

α -glycosyl rutin, ferulic acid, furfurylidene glucitol, carnosine, butylhydroxytoluene, butylhydroxyanisole, nordihydroguaiacic acid, nordihydroguaiaretic acid, trihydroxybutyrophenone, uric acid and its derivatives, mannose and its derivatives, zinc and its derivatives (for example ZnO, ZnSO₄), selenium and its derivatives (for example selenium methionine), stilbenes and their derivatives (stilbene oxide, trans-stilbene oxide) and derivatives (salts, esters, ethers, sugars, nucleotides, nucleosides, peptides and lipids) of the above-mentioned agents that are useful in accordance with the invention. Also favourable are cosmetic and dermatological preparations that are in the form of a sun-protecting composition. Preferably these contain, in addition to the active agent combinations of the invention, at least one UV-A filter and/or at least one UV-B filter and/or at least one inorganic pigment.

It is also advantageous for the purpose of the present invention to provide cosmetic and dermatological preparations whose main use is not to give protection against sunlight but which nonetheless contain UV-protective substances. For example, UV-A and UV-B filters are normally incorporated in day creams.

UV-protecting substances, as well as antioxidants and if desired preservatives, are also an effective means of protecting the preparations against spoilage.

Advantageously, the preparations of the invention can also contain substances that absorb UV radiation in the UV-B region, the total amount of filters being for example from 0.1% by weight to 30% by weight, preferably 0.5% to 10% by weight, and in particular from 1.0 to 6.0% by weight, calculated on the total weight of the preparations, in order to provide cosmetic preparations that protect the hair or the skin from the whole spectrum of ultraviolet radiation. They can also be used as sun protection compositions for the hair or for the skin.

If the preparations of the invention contain UVB filters, these can be oil-soluble or water-soluble. Oil-soluble UVB filters that are advantageous in accordance with the invention are for example:

- 3-benzylidene camphor derivatives, for example 3-(4-methylbenzylidene) camphor, 3-benzylidene camphor;
- 4-aminobenzoic acid derivatives, preferably 4-(dimethylamino)-benzoic acid -(2-ethylhexyl) ester, 4-(dimethylamino)benzoic acid amyl ester;
- esters of cinnamic acid, preferably 4-methoxycinnamic acid (2-ethylhexyl) ester, 4-methoxy- cinnamic acid isopentyl ester;
- esters of salicylic acid, preferably salicylic acid (2-ethylhexyl) ester, salicylic acid (4-isopropyl benzyl) ester, salicylic homomenthyl ester;
- derivatives of benzophenone, preferably 2-hydroxy-4-methoxybenzophenone, 2-hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenone, 2,2'-dihydroxy-4-methoxybenzophenone; esters of benzalmalonic acid, preferably 4-methoxybenzal malonic acid di-(2-ethylhexyl) ester;
- derivatives of 1,3,5-triazine, preferably 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazine.

The above list of UVB filters that can be used together with the active agent combination in accordance with the invention is not of course intended to be limiting.

It can also be an advantage to formulate the preparations of the invention with UVA filters of the kind that are usually contained in cosmetic preparations. These filters are preferably the derivatives of dibenzoylmethane, in particular 1-(4'-tert.-butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)-propane-1,3-dione and 1-phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)-propane-1,3-dione.

The invention therefore also relates to combinations of the active agents of the invention, in particular in topical preparations, with antioxidants, substances involved in aerobic cellular energy metabolism, and/or UV absorbers, which improve for example the stability and the effectiveness of the preparation.

The examples of combinable active agents selected from the groups mentioned above serve to illustrate the invention without limiting it.

In addition, protective types of formulation can be used in which the substances of the invention are for example enclosed (encapsulated) in liposomes, micelles, nanospheres and the like consisting for example of amphiphilic materials such as for example ceramides, fatty acids, sphingomyelin and phosphoglycerides, or in cyclodextrans. Additional protection can be obtained by using a protective gas (e.g. N₂, CO₂) during formulation, and by employing gas-tight packaging.

Other adjuncts and additives can include water-binding substances, thickeners, fillers, perfume, dyes, emulsifiers, active agents such as vitamins, preservatives, water and/or salts.

The substance groups of the invention can be incorporated into any cosmetic base. However, W/O and O/W and W/O/W emulsions, hydrodispersions and lipodispersions are generally

preferred. Especially advantageously, the combinations of the invention can be used in care products such as for example O/W creams, W/O creams, O/W lotions and the like.

The lipid phase can be advantageously selected from the following group of substances:

- Mineral oils, mineral waxes,
- Oils such as the triglycerides of capric acid or caprylic acid, or preferably castor oil;
- Fats, waxes and other natural and synthetic fatty substances, preferably esters of fatty acids with alcohols having a low number of C atoms, e.g. with isopropanol, propylene glycol or glycerol, or esters of fatty alcohols with alkanolic acid having a low number of C atoms, or with fatty acids;
- Alkyl benzoates
- Silicone oils such as dimethyl polysiloxanes, diethyl polysiloxanes, diphenylpolysiloxanes and mixtures thereof.

The oil phase of the emulsions, oleogels or hydrodispersions or lipodispersions in accordance with the present invention is advantageously selected from the group comprising the esters of saturated and/or unsaturated, branched and/or unbranched alkylcarboxylic acids having a chain length of from 3 to 30 C atoms and saturated and/or unsaturated, branched or unbranched alcohols having a chain length of from 3 to 30 C atoms, and from the group comprising the esters of aromatic carboxylic acids and saturated and/or unsaturated, branched and/or unbranched alcohols having a chain length of from 3 to 30 C atoms. These ester oils can be advantageously selected from the group comprising isopropyl myristate, isopropyl palmitate, isopropyl stearate, isopropyl oleate, n-butyl stearate, n-hexyl laurate, n-decyl oleate, isooctyl stearate, isononyl stearate, isononyl isononanoate, 2-ethylhexyl palmitate, 2-ethylhexyl laurate, 2-hexyldecyl stearate, 2-octyldodecyl palmitate, oleyl oleate, oleyl erucate, erucyl oleate, erucyl erucate, as well as synthetic, semi-synthetic and natural mixtures of such esters, for example jojoba oil.

The oil phase can also be advantageously selected from the group of branched and unbranched hydrocarbons and waxes, silicone oils, dialkyl ethers, the group of saturated or unsaturated, branched or unbranched alcohols, and the group of fatty acid triglycerides,

namely the triglycerol esters of saturated and/or unsaturated, branched or unbranched alkyl carboxylic acids having a chain length of from 8 to 24 and in particular from 12 to 18 C atoms. The fatty acid triglycerides can for example be selected from the group of synthetic, semi-synthetic and natural oils, for example olive oil, sunflower oil, soya oil, groundnut oil, rapeseed oil, almond oil, palm oil, coconut oil, palm kernel oil and the like.

Any blends of such oil and wax components are also advantageously used for the purposes of the invention. It can also be advantageous to use waxes, for example cetyl palmitate, as the sole lipid component of the oil phase.

Advantageously, the oil phase is selected from the group comprising 2-ethylhexyl isostearate, octyl dodecanol, isotridecyl isononanoate, isoeicosan, 2-ethylhexyl cocoate, C₁₂₋₁₅ alkyl benzoate, caprylic/capric triglyceride and dicaprylyl ether.

Especially advantageous are mixtures of C₁₂₋₁₅ alkyl benzoate and 2-ethylhexyl isostearate, mixtures of C₁₂₋₁₅ alkyl benzoate and isotridecyl isononanoate, as well as mixtures of C₁₂₋₁₅ alkyl benzoate, 2-ethylhexyl isostearate and isotridecyl isononanoate.

Of the hydrocarbons, paraffin oil, squalane and squalene can be advantageously used for the purpose of the present invention.

Advantageously, the oil phase can also contain cyclic or linear silicone oils or it can consist entirely of these oils, it being preferred however that other oil phase components be used in addition to the silicone oil or oils.

Advantageously, cyclomethicone (octamethylcyclotetrasiloxane) is used as the silicone oil of the invention. However, other silicone oils are advantageously used for the purpose of the invention, for example hexamethylcyclotrisiloxane, polydimethylsiloxane, poly(methylphenylsiloxane).

Also especially advantageous are mixtures of cyclomethicone and isotridecyl isononanoate, and of cyclomethicone and 2-ethylhexyl isostearate.

The aqueous phase of the preparations of the invention can advantageously contain:

- alcohols, diols or polyols of low C number as well as their ethers, preferably ethanol, isopropanol, propylene glycol, glycerol, ethylene glycol, ethylene glycol monoethyl or monobutyl ether, propylene glycol monomethyl, monoethyl or monobutyl ethers, diethylene glycol monomethyl or monoethyl ether and similar products, as well as alcohols of low C number, for example ethanol, isopropanol, 1,2-propanediol, glycerol and in particular one or more thickeners which can be advantageously selected from the group comprising silicon dioxide, aluminium silicates, polysaccharides or their derivatives, for example hyaluronic acid, xanthan gum, hydroxypropylmethylcellulose, and especially advantageously from the group of the polyacrylates, preferably a polyacrylate from the group of the Carbopols, for example Carbopol types 980, 981, 1382, 2984, 5984, either alone or in combination.

Technically, gels are understood to be relatively dimensionally-stable easily deformed disperse systems of at least two components which are generally: a - usually solid - colloiddally dispersed material consisting of groups of long-chain molecules (e.g. gelatine, silica, polysaccharides) as the framework, and a liquid disperse phase (e.g. water). The colloiddally-dispersed material is often referred to as a thickener or gelling agent. It forms a three-dimensional network in the disperse phase, in which individual colloidal particles can be more or less firmly linked to one another by electrostatic interaction. The disperse phase that surrounds the network has an electrostatic affinity for the gelling agent, in other words, a mainly polar (in particular: hydrophilic) gelling agent preferentially gels a polar disperse phase (in particular water), while a mainly nonpolar gelling agent preferentially gels nonpolar disperse phases.

Strong electrostatic interactions, for example hydrogen bridges between gelling agent and disperse phase, and between molecules of the disperse phase, can result in a pronounced cross-linking of the disperse phase. Hydrogels can consist of almost 100% water (in addition to for example about 0.2 - 1.0% of a gelling agent) and yet have a solid consistency. The water is contained in ice-like structural elements, so that gels really do live up to their name [from the Latin "gelatum" = "frozen material", via the alchemist term "gelatina" (16th century) for New High German "Gelatine"].

Gels in accordance with the invention will usually contain alcohols of low C number, for example ethanol, isopropanol, 1,2-propanediol, glycerol and water in the presence of a thickener, which in the case of oily-alcoholic gels is preferably silicon dioxide or an aluminium silicate, and in the case of aqueous-alcoholic or alcoholic gels preferably a polyacrylate.

Preparations in accordance with the invention can be formulated as foam or shower baths, solid and liquid soaps, or so-called syndets (synthetic detergents), shampoos, hand-washing pastes, intimate hygiene washing products, speciality cleansing products for infants, and the like.

The preparations of the invention can also advantageously contain surfactants. Surfactants are amphiphilic materials that can dissolve organic non-polar substances in water. Because of their specific molecular structure, with at least one hydrophilic and one hydrophobic moiety, they are able to lower the surface tension of water, to wet the skin, make it easier to remove and dissolve soiling, improve rinsability and - if required - regulate lathering.

The hydrophilic moieties of a surfactant molecule are usually polar functional groups, for example $-\text{COO}^-$, $-\text{OSO}_3^{2-}$, $-\text{SO}_3^-$, while the hydrophobic moieties are normally non-polar hydrocarbon residues. Surfactants are generally classified by the nature and electrical charge of the hydrophilic moiety of the molecule. There are four groups:

- anionic surfactants
- cationic surfactants
- amphoteric surfactants, and
- nonionic surfactants.

Anionic surfactants generally contain carboxylate, sulphate or sulphonate groups as the functional groups. In aqueous solution, they form negatively-charged organic ions in an acid or neutral medium. Cationic surfactants are almost exclusively characterised by the presence of a quaternary ammonium group. In aqueous solution, they form positively-charged organic ions in an acid or neutral medium. Amphoteric surfactants contain both anionic and cationic

groups and behave like anionic or cationic surfactants in aqueous solution, depending on the pH. In a strongly acidic medium, they have a positive charge and in an alkaline medium they have a negative charge. When the pH is neutral they are zwitterionic, as the following example shows:

$\text{RNH}_2^+\text{CH}_2\text{CH}_2\text{COOH} \quad \text{X}^-$ (at pH = 2) X^- = any anion, e.g. Cl^-

$\text{RNH}_2^+\text{CH}_2\text{CH}_2\text{COO}^-$ (at pH = 7)

$\text{RNHCH}_2\text{CH}_2\text{COO}^- \quad \text{B}^+$ (at pH = 12) B^+ = any cation, e.g. Na^+

Polyether chains are typical of nonionic surfactants. Nonionic surfactants do not form ions in aqueous medium.

A. Anionic surfactants

Advantageous anionic surfactant are acylamino acids (and their salts) such as

1. Acyl glutamates, for example sodium acylglutamate, di-TEA-palmitoyl aspartate and sodium caprylic/capric glutamate,
2. Acyl peptides, for example palmitoyl hydrolysed milk protein, sodium cocoyl hydrolysed soya protein and sodium/potassium cocoyl hydrolysed collagen,
3. Sarcosinates, for example myristoyl sarcosine, TEA-lauroyl sarcosinate, sodium lauroyl sarcosinate, and sodium cocoyl sarcosinate
4. Taurates, for example sodium lauroyl taurate and sodium methylcocoyl taurate
5. Acyl lactylates, lauroyl lactylate, caproyl lactylate
6. Alaninates

Carboxylic acids and derivatives such as

1. Carboxylic acids, for example lauric acid, aluminium stearate, magnesium alkanolate and zinc undecylate
2. Ester carboxylic acids, for example calcium stearyl lactylate, laureth-6 citrate and sodium PEG-4 lauramide carboxylate
3. Ether carboxylic acids, for example sodium laureth-13 carboxylate and sodium PEG-6 cocamide carboxylate;

Phosphoric acid esters and salts, such as for example DEA-o-leth-10 phosphate and dilaureth-4 phosphate;

Sulphonic acids and salts such as

1. Acyl isethionates, for example sodium/ammonium cocoyl isethionate
2. Alkylarylsulphonates
3. Alkyl sulphonates, for example sodium cocomonoglyceride sulphate, sodium C₁₂₋₁₄ olefin sulphonate, sodium lauryl sulfoacetate and magnesium PEG-3 cocamide sulphate,
4. Sulphosuccinates, for example dioctyl sodium sulphosuccinate, disodium laureth sulphosuccinate, disodium laurylsulphosuccinate and disodium undecyleneamido MEA sulphosuccinate

as well as

Sulphuric acid esters such as

1. Alkyl ether sulphate, for example sodium, ammonium, magnesium, MIPA, TIPA laureth sulphate, sodium myreth sulphate and sodium C₁₂₋₁₃ pareth sulphate,
2. Alkyl sulphates, for example sodium, ammonium and TEA lauryl sulphate.

B. Cationic surfactants

Cationic surfactants that can be advantageously used are

1. Alkyl amines
2. Alkyl imidazoles
3. Ethoxylated amines and
4. Quaternary surfactants
5. Ester quats.

Quaternary surfactants contain at least one N atom covalently bonded to four alkyl or aryl groups. This results in a positive charge, irrespective of pH. Alkyl betaine, alkylamidopropyl betaine and alkylamidopropyl hydroxysulphaine are advantageous. The cationic surfactants used in accordance with the invention can also be preferably chosen from the group comprising quaternary ammonium compounds, in particular benzyltrialkylammonium

chlorides or bromides, such as for example benzyldimethylstearylammmonium chloride, as well as alkyltrialkylammmonium salts, for example cetyltrimethylammmonium chloride or bromide, alkyl dimethylhydroxyethylammmonium chlorides or bromides, dialkyldimethylammmonium chlorides or bromides, alkylamidoethyltrimethylammmonium ether sulphates, alkylpyridinium salts, for example lauryl or cetylpyrimidinium chloride, imidazoline derivatives and compounds with a cationic character, such as amine oxides, for example alkyl dimethyl amine oxides or alkylaminoethyl dimethyl amine oxides. Cetyltrimethylammmonium salts in particular are advantageously used.

C. Amphoteric surfactants

Amphoteric surfactants that can be advantageously used are

1. Acyl-/dialkyl ethylene diamine, for example sodium acyl amphotacetate, disodium acyl amphodipropionate, disodium alkylamphodiactate, sodium acylamphohydroxypropyl sulphate, disodium acylamphodiactate and sodium acylamphopropionate,
2. N-alkylamino acids, for example aminopropyl alkylglutamide, alkylaminopropionic acid, sodium alkyl imidodipropionate and lauroamphocarboxy glycinate.

D. Nonionic surfactants

Nonionic surfactants that can be advantageously used are

1. Alcohols
2. Alkanolamides such as cocamide MEA/DEA/MIPA
3. Amine oxide such as cocoamidopropylamine oxide
4. Esters obtained by esterifying carboxylic acids with ethylene oxide, glycerol, sorbitan or other alcohols
5. Ethers for example ethoxylated/propoxylated alcohols, ethoxylated/propoxylated esters, ethoxylated/propoxylated glycerol esters, ethoxylated/propoxylated cholesterol, ethoxylated/propoxylated triglycerides, ethoxylated/propoxylated lanolin, ethoxylated/propoxylated polysiloxanes, propoxylated POE ethers and alkylpolyglycosides such as lauryl glucoside, decyl glycoside and coco glycoside
6. Sucrose esters, ethers
7. Polyglycerol esters, diglycerol esters, monoglycerol esters

8. Methyl glucose esters, esters of hydroxy acids.

The examples following below are intended to illustrate the invention. Quantities, percentages and parts refer, unless otherwise stated, to weight, in particular the total weight of the preparations or of the mixture to which they relate.

Example 1

O/W cream

| | wt-% |
|---------------------------------------|-------------------|
| Glyceryl stearate | 5.00 |
| Cetyl alcohol | 5.00 |
| Isopropyl palmitate | 7.00 |
| Cyclomethicone | 5.00 |
| Ascorbic acid | 0.30 |
| Camellia sinensis (green tea extract) | 0.30 |
| NaOH 45% | 1.00 |
| Butylene glycol | 3.00 |
| Na ₂ H ₂ EDTA | 0.20 |
| Ethanol | 2.00 |
| Dyes, perfume, preservative | q.s. |
| Water | balance to 100.00 |

The oil phase components were combined and the mixture was homogenized, then mixed with the water phase at 60-70 °C and homogenized. The mixture was then cooled to room temperature.

Example 2

O/W lotion

| | wt-% |
|---------------------------------------|-------------------|
| Steareth 20 | 3.00 |
| Cetyl alcohol | 3.00 |
| Cyclomethicone | 6.00 |
| Carbomer | 0.60 |
| Na ₂ H ₂ EDTA | 0.20 |
| Butylene glycol | 3.00 |
| NaOH 45% | 0.40 |
| Ascorbic acid | 0.50 |
| Camellia sinensis (green tea extract) | 0.10 |
| Ethanol | 1.00 |
| Dyes, perfumes, preservatives | q.s. |
| Water | balance to 100.00 |

Example 3

W/O cream

| | wt-% |
|---------------------------------------|-------------------|
| Polyglyceryl 2-dipolyhydroxystearate | 5.00 |
| Caprylic/Capric Triglycerides | 15.00 |
| Butylene glycol | 3.00 |
| Na ₂ H ₂ EDTA | 0.20 |
| MgSO ₄ | 0.70 |
| NaOH 45% | 0.32 |
| Ascorbic acid | 1.00 |
| Camellia sinensis (green tea extract) | 0.20 |
| Ethanol | 1.00 |
| Dyes, perfumes, preservatives | q.s. |
| Water | balance to 100.00 |

Example 4

O/W gel

| | wt-% |
|---------------------------------------|-------------------|
| Xanthan gum | 2.00 |
| Butylene glycol | 3.00 |
| Na ₂ H ₂ EDTA | 0.20 |
| NaOH 45% | 0.32 |
| Ascorbic acid | 1.00 |
| Camellia sinensis (green tea extract) | 0.50 |
| Ethanol | 1.00 |
| Dyes, perfumes, preservatives | q.s. |
| Water | balance to 100.00 |

Example 5

O/W hair conditioner

| | |
|---------------------------------------|-------------------|
| Bis-diglyceryl polyacyladipate | 3.00 |
| Behenyl alcohol | 4.00 |
| Butylene glycol | 3.00 |
| Cetrimonium chloride | 5.00 |
| Citric acid | 0.50 |
| Na ₂ H ₂ EDTA | 0.20 |
| NaOH 45% | 0.16 |
| Ascorbic acid | 0.50 |
| Camellia sinensis (green tea extract) | 0.10 |
| Dyes, perfumes, preservatives | q.s. |
| Water | balance to 100.00 |

Claims

1. Active agent combinations of

- (a) Extracts of the leaves of plants of the order Theales and family Theaceae, particularly of the species *Camellia*, more particularly the tea varieties *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* and *C. irrawadiensis* and hybrids thereof with for example *Camellia japonica*, and/or
- (b) Catechins and/or
- (c) Gallic acid esters of catechins and
- (d) One or more ascorbyl compounds, in particular one or more water-soluble ascorbyl compounds, in particular ascorbic acid.

2. Use of

- (d) one or more ascorbyl compounds, in particular one or more water-soluble ascorbyl compounds, in particular ascorbic acid
to stabilise or improve the storage stability of
- (a) Extracts of the leaves of plants of the order Theales and family Theaceae, particularly of the species *Camellia*, more particularly the tea varieties *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* and *C. irrawadiensis* and hybrids thereof with for example *Camellia japonica*, and/or
- (b) Catechins and/or
- (c) Gallic acid esters of catechins.

3. Active agent combinations according to claim 1, or use according to claim 2, characterised in that the catechin or catechins is/are selected from the group comprising (-)-catechin, (+)-catechin, (-)-catechin gallate, (-)-gallocatechin gallate, (+)-epicatechin, (-)-epicatechin, (-)-epicatechin gallate, (-)-epigallocatechin, (-)-epigallocatechin gallate.

4. Active agent combinations according to claim 1, or use according to claim 2, characterised in that the ascorbyl compound is selected from the group comprising vitamin C and derivatives such as for example ascorbyl palmitate, Mg ascorbyl phosphate and ascorbyl acetate.

5. Active agent combinations according to claim 1, or use according to claim 2 in cosmetic or dermatological preparations containing plant extracts that contain catechins, in particular preparations containing green tea extracts.

6. Active agent combinations according to claim 1, or use according to claim 2 in cosmetic or dermatological preparations containing from 0.0001 to 20% by weight, preferably from 0.001 to 10% by weight, more preferably from 0.01 to 1% by weight of catechins or the gallic acid esters of catechins, or the aqueous or organic extracts of plants or plant parts that contain catechins or the gallic acid esters of catechins, preferably polyphenols or catechins in the group comprising (-)-catechin, (+)-catechin, (-)-catechin gallate, (-)-gallocatechin gallate, (+)-epicatechin, (-)-epicatechin, (-)-epicatechin gallate, (-)-epigallocatechin, (-)-epigallocatechin gallate.

7. Active agent combinations according to claim 1, or use according to claim 2 in cosmetic or dermatological preparations containing one or more ascorbyl compounds, in particular ascorbic acid, from 0.001 % by weight to 10% by weight, preferably from 0.05% by weight to 5% by weight, and more preferably from 0.1 to 2.0% by weight of one or more ascorbyl compounds, in particular vitamin C and/or derivatives such as for example ascorbyl palmitate, Mg ascorbyl phosphate, ascorbyl acetate, calculated on the total weight of the preparations.

19 BUNDESREPUBLIK

DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENT- UND
MARKENAMT

12 **Offenlegungsschrift**
10 **DE 199 62 369 A 1**

61 Int. Cl. 7:
A 61 K 7/00
A 61 K 7/48
A 61 K 35/78

21 Aktenzeichen: 199 62 369.4
22 Anmeldetag: 23. 12. 1999
23 Offenlegungstag: 28. 6. 2001

DE 199 62 369 A 1

71 Anmelder:
Beiersdorf AG, 20253 Hamburg, DE

72 Erfinder:
Schönrock, Uwe, Dr., 23866 Nahe, DE; Rapp,
Claudius, Dr., 20257 Hamburg, DE; Steinke, Sigrid,
21075 Hamburg, DE; Frauen, Markus, 20251
Hamburg, DE; Rode, Timo, 20255 Hamburg, DE

56 Für die Beurteilung der Patentfähigkeit in Betracht
zu ziehende Druckschriften:

DE 198 38 918 A1
DE 198 27 624 A1
DE 198 24 727 A1
US 59 72 999
US 59 62 517
US 57 80 086
WO 99 13 859 A1
WO 98 23 162 A1

JP Patents Abstracts of Japan:
59-227244 A., C- 278, April 25, 1985, Vol. 9, No. 96;
59-227243 A., C- 278, April 25, 1985, Vol. 9, No. 96;
09309833 A;
08119849 A;
07025742 A;

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

- 54 Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen mit einem Gehalt an Catechinen oder einem Gehalt an Extrakt von grünem Tee und einem weiteren Gehalt an Ascorbinsäure
- 57 Wirkstoffkombinationen aus
- (a) Extrakten aus Blättern der Pflanzen der Ordnung Theales mit der Familie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia spec.*, ganz besonders der Teesorten *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* bzw. *C. irrawadiensis* und Kreuzungen aus diesen mit beispielsweise *Camellia japonica* und/oder
 - (b) Catechinen und/oder
 - (c) Gallussäureestern von Catechinen und
- (d) einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere einer oder mehreren wasserlöslichen Ascorbylverbindungen, insbesondere Ascorbinsäure.

DE 199 62 369 A 1

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft kosmetische bzw. dermatologische Zubereitungen, enthaltend Wirkstoffe zur Pflege und zum Schutze der Haut, insbesondere der empfindlichen und trockenen Haut wie auch ganz besonders im Vordergrund stehend der durch intrinsische und/oder extrinsische Faktoren gealterten oder alternenden Haut sowie die Verwendung solcher Wirkstoffe und Kombinationen solcher Wirkstoffe auf dem Gebiete der kosmetischen und dermatologischen Hautpflege.

Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umweltinflüsse (z. B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z. B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliches Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor Umweltinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

Die Hornschicht der Haut zeichnet sich durch eine besondere Struktur aus, die einerseits die Haut vor Verlust an lebenswichtigem Zellwasser bzw. dem Eindringen von externen Noxen schützt und andererseits ihre eigene Flexibilität durch Bindung einer definierten Wassermenge stabilisiert: Interzellularlipide, bestehend aus freien Sterolen und Fettsäuren sowie verschiedenen Ceramidklassen, bilden innerhalb der Hornschicht eine Barriere in Form extrazellulärer, multi-lamellarer und wasserundurchlässiger Membransysteme aus.

Die Lipidmembranen umlagern die abgestorbenen Kerneocyten mit eingelagerten hygrokopischen Stoffen. Die Hornschicht befindet sich in einem ständigen Erneuerungsprozess, wobei nach außen kontinuierlich feine Schuppen (Korneocyten mit anhaftenden Lipiden) abgegeben und von innen verhorntes Zell- und Lipidmaterial nachproduziert wird. Im Gleichgewicht verursacht der Regenerationsprozess also keine Veränderung des transepidermalen Wasserverlustes.

Schon bei einem einfachen Wasserbade ohne Zusatz von Tensiden kommt es zunächst zu einer Quellung der Hornschicht der Haut, wobei der Grad dieser Quellung beispielsweise von der Dauer des Bades und dessen Temperatur abhängt. Zugleich werden wasserlösliche Stoffe, z. B. wasserlösliche Schmutzbestandteile, aber auch hauteigene Stoffe, die für das Wasserbindungsvermögen der Hornschicht verantwortlich sind, ab- bzw. ausgewaschen. Durch hauteigene oberflächenaktive Stoffe werden zudem auch Hautfette in gewissem Ausmaße gelöst und ausgewaschen. Dies bedingt nach anfänglicher Quellung eine nachfolgende deutliche Austrocknung der Haut, die durch wachstaktive Zusätze noch verstärkt werden kann.

Bei gesunder Haut sind diese Vorgänge im allgemeinen belanglos, da die Schutzmechanismen der Haut solche leichten Störungen der oberen Hautschichten ohne weiteres kompensieren können. Aber bereits im Falle nichtpathologischer Abweichungen vom Normalstatus, z. B. durch umweltbedingte Abnutzungsschäden bzw. Irritationen, Lichtschäden, Altershaut usw., ist der Schutzmechanismus der Hautoberfläche gestört. Unter Umständen ist er dann aus eigener Kraft nicht mehr in der Lage, seine Aufgabe zu erfüllen und muß durch externe Maßnahmen regeneriert werden.

Darüber hinaus ist bekannt, daß Lipidzusammensetzung und -menge der Hornschicht der pathologisch veränderten, trockenen und der trockenen, jedoch nicht erkrankten Haut jüngerer und älterer Menschen vom Normalzustand abweicht, der in der gesunden, normal hydrierten Haut einer gleichalten Altersgruppe vorgefunden wird. Dabei stellen die Veränderungen im Lipidmuster der sehr trockenen, nicht-ekzematösen Haut von Patienten mit atopischem Ekzem einen Extremfall für die Abweichungen dar, die in der trockenen Haut hautgesunder Menschen vorgefunden werden.

Diese Abweichungen betreffen dabei ganz besonders die Ceramide, die in ihrer Menge stark reduziert und zusätzlich anders zusammengesetzt sind. Auffallend ist dabei in besonderer Weise das Defizit an den Ceramiden 1 und 3, wobei insbesondere für das Ceramid 1 bekannt ist, daß es in besonderer Weise die Ordnung der Lipide in den Interzellularmembransystemen steuert.

Nachteile Veränderungen in den Lipidmembranen der vorab geschilderten Art beruhen möglicherweise auf fehlgesteuerter Lipidbiosynthese und erhöhen ebenfalls im Endeffekt den transepidermalen Wasserverlust. Eine langanhaltende Barrierschwäche wiederum macht die an sich gesunde Haut empfindlicher und kann im Einzelfalle zum Entstehen ekzematöser Vorgänge in der kranken Haut beitragen.

Die Wirkung von Salben und Cremes auf Barrierefunktion und Hydratation der Hornschicht besteht in der Regel nicht in einer Wiederherstellung bzw. Stärkung der physikalisch-chemischen Eigenschaften der Lamellen aus Interzellular-lipiden. Ein wesentlicher Teileffekt beruht auf der bloßen Abdeckung der behandelten Hautbereiche und dem daraus resultierenden Wasserstau in der darunterliegenden Hornschicht. Coapplizierte hygrokopische Substanzen binden das Wasser, so daß es zu einer meßbaren Zunahme des Wassergehaltes in der Hornschicht kommt. Diese rein physikalische Barriere kann jedoch relativ leicht wieder entfernt werden. Nach dem Absetzen des Produktes kehrt die Haut dann sehr schnell wieder den Zustand vor Behandlungsbeginn zurück. Darüber hinaus kann die Hautpflegewirkung bei regelmäßiger Behandlung nachlassen, so daß schließlich sogar während der Behandlung der Status quo wieder erreicht wird. Bei bestimmten Produkten verschlechtert sich der Zustand der Haut nach Absetzen unter Umständen vorübergehend. Eine nachhaltige Produktwirkung wird in der Regel also nicht oder nur in einem eingeschränkten Maße erreicht.

Um die defizitiäre Haut bei ihrer natürlichen Regeneration zu unterstützen und ihre physiologische Funktion zu stärken, werden topischen Präparaten in neuerer Zeit zunehmend Interzellularlipidmischungen zugesetzt, die von der Haut zum Wiederaufbau der natürlichen Barriere verwendet werden sollen. Allerdings handelt es sich bei diesen Lipiden, insbesondere aber den Ceramiden, um sehr teure Rohstoffe. Zudem ist ihre Wirkung meist sehr viel geringer als erhofft.

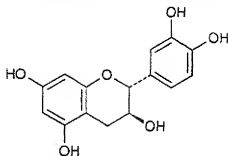
Ziel der vorliegenden Erfindung war es somit, Wege zu finden, die Nachteile des Standes der Technik zu vermeiden. Insbesondere sollte die Wirkung der Hautpflegeprodukte physiologisch, schnell und nachhaltig sein.

Erfindungsgemäß werden diese Aufgaben gelöst durch Gegenstand der Erfindung sind ferner die Verwendung von Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen oder wäßriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzenteilen.

len, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia sinensis* (grüner Tee) bzw. deren typische Inhaltsstoffe (wie z. B. Polyphenole bzw. Catechine, Coffein, Vitamine, Zucker, Mineralien, Aminosäuren, Lipide), zur Prophylaxe, Behandlung und/oder Pflege trockener Hautzustände.

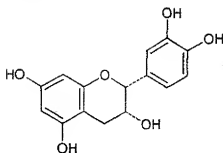
Catechine stellen eine Gruppe von Verbindungen dar, die als hydrierte Flavone oder Anthocyanidine aufzufassen sind. Die Catechine bilden die Grundsubstanz einer Reihe natürlicher oligo- oder polymerer Gerbstoffe. z. B. im Tee. Sie kommen zusammen mit anderen Phenolen in vielen Obstsorten vor und sind an der durch Phenoloxidasen katalysierten Bräunung von Druck- und Schnittstellen (z. B. bei Äpfeln) beteiligt.

Der Grundkörper, das "Catechin" (Catechol, 3,3',4',5,7-Flavanpentaol, 2-(3,4-Dihydroxyphenyl)-chroman-3,5,7-triol) ist weitverbreitet in Pflanzen und kommt beispielsweise im Catechu vor. Es ist durch die Strukturformel



gekennzeichnet.

Das Epicatechin ((2R,3R)-3,3',4',5,7-Flavanpentaol) stellt ein Epimeres des Catechins dar und ist durch die Strukturformel



gekennzeichnet.

Die erfindungsgemäßen Aufgaben werden ebenfalls gelöst durch kosmetische oder dermatologische Zubereitungen enthaltend pflanzliche Auszüge mit einem Gehalt an Catechinen, insbesondere solche Zubereitungen, die Extrakte des grünen Tees enthalten.

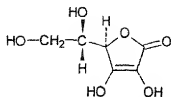
Tee stammt ausschließlich aus Blättern, Blattknospen und zarten Stielen des Teestrauchs (*Camellia sinensis* L.), die nach Verfahren wie Welken, Rollen, Fermentieren, Zerkleinern und Trocknen bearbeitet werden. Schwarzer Tee ist ein fermentierter Tee, Oolong-Tee ist ein halb fermentierter Tee, dessen Blätter nach Welken u. Rollen nur die Hälfte der sonst üblichen Zeit fermentiert und anschließend getrocknet werden. Grüner Tee ist ein unfermentiertes Erzeugnis, dessen Blätter blanchiert, gerollt und unter Erhalt der natürlichen Blattfarbstoffe getrocknet werden.

Die Zusammensetzung der Inhaltsstoffe der Teeblätter schwankt je nach Herkunft und Behandlung beträchtlich. Im Durchschnitt enthält schwarzer Tee 18,9% Catechine und Catechin-Gerbstoffe, 16,6% Proteine, 2,7% Coffein, 10,2% andere Stickstoffverbindungen, 4,6% Oligosaccharide, 0,6% Stärke, 11,9% Pektin, 7,9% Cellulose und 6,1% Lignin. Frische Blätter weisen im wesentlichen die gleiche Zusammensetzung auf, enthalten jedoch mehr Catechine (26%), weniger Stickstoffverbindungen (8,7%, bei gleichem Coffein-Gehalt) sowie 0,8% Inosit. In den Polyphenol-Gerbstoffen finden sich zu etwa 80% Catechine (Hauptbestandteil Galloyl(-)-epigallocatechin).

Nachteilig an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen oder wässriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia sinensis* (Grüner Tee), ist, daß ihre Lagerstabilität äußerst knapp begrenzt ist. Bereits nach für kosmetische oder dermatologische Zubereitungen inakzeptabel kurzer Zeit degenerieren diese Substanzen, wodurch ihre physiologische Wirksamkeit bereits rasch herabgesetzt bzw. gänzlich zunichte gemacht wird.

Diesem Uebelstande gilt es, Abhilfe zu schaffen.

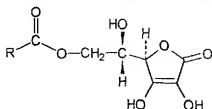
Die Verwendung der Ascorbinsäure in Kosmetika und Dermatika ist an sich bekannt. L-Ascorbinsäure [(R)-5-[(S)-1,2-Dihydroxyethyl]-3,4-dihydroxy-5-H-furan-2-on, Vitamin C] zeichnet sich durch die Strukturformel



aus. Sie ist leicht löslich in Wasser, gut löslich in Alkohol, unlöslich in Ether, Petrolether, Chloroform. Benzol sowie in Fetten u. fetten Ölen. Ascorbinsäure ist ein Endiol und wirkt als Reduktion stark reduzierend. Ascorbinsäure ist wärmeempfindlich und wird insbesondere in Gegenwart von Schwermetallspuren sowie in alkalischem Milieu durch Licht und Luftsauerstoff zersetzt, in reinem, trockenem Zustand ist sie dagegen relativ beständig gegen Licht, Luft und Wärme.

In kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen werden anstatt der Ascorbinsäure oftmals Ascorbylverbindungen, bevorzugt Ascorbylester von Fettsäuren, besonders bevorzugt Ascorbylpalmitat eingesetzt, da die Empfindlichkeit dieser Verbindungen auf oxidativen Einfluß gegenüber der Ascorbinsäure stark herabgesetzt ist und diese Verbindungen zumist besser löslich sind, was galenische Vorteile bieten kann.

Ascorbylverbindungen im engeren Sinne sind insbesondere die Ascorbylester der allgemeinen Struktur



wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkylrest mit bis zu 25 Kohlenstoffatomen darstellen kann.

Überraschenderweise wurde gefunden, daß Wirkstoffkombinationen aus

(a) Extrakten aus Blättern der Pflanzen der Ordnung Theales mit der Familie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia spec.*, ganz besonders der Teesorten *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* bzw. *C. irrawadiensis* und Kreuzungen aus diesen mit beispielsweise *Camellia japonica* und/oder

(b) Catechinen und/oder

(c) Gallussäureestern von Catechinen und

(d) einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere einer oder mehreren wasserlöslichen Ascorbylverbindungen, insbesondere Ascorbinsäure,

die Aufgaben erfindungsgemäß lösen.

Gegenstand der Erfindung ist ferner die Verwendung

(d) einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere einer oder mehreren wasserlöslichen Ascorbylverbindungen, insbesondere Ascorbinsäure,

zur Stabilisierung bzw. Verbesserung der Lagerfähigkeit von

(a) Extrakten aus Blättern der Pflanzen der Ordnung Theales mit der Familie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia spec.*, ganz besonders der Teesorten *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* bzw. *C. irrawadiensis* und Kreuzungen aus diesen mit beispielsweise *Camellia japonica* und/oder

(b) Catechinen und/oder

(c) Gallussäureestern von Catechinen.

Die Verwirklichung der Erfindung findet bevorzugt in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen statt, insbesondere bevorzugt in Hautpflegeprodukten.

Vorteilhaft enthalten erfindungsgemäße Zubereitungen 0,0001–20 Gew.-% an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen oder an wäßrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen aufweisen, vorzugsweise Polyphenole bzw. Catechine aus der Gruppe (-)-Catechin, (+)-Catechin, (-)-Gallocatechingallat, (-)-Gallocatechingallat, (+)-Epicatechin, (-)-Epicatechin, (-)-Epicatechingallat, (-)-Epigallocatechin, (-)-Epigallocatechingallat.

Bevorzugt enthalten kosmetische oder dermatologische Zubereitungen gemäß der Erfindung 0,001–10 Gew.-% an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen oder an wäßrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen aufweisen, bezogen auf die Gesamtzusammensetzung der Zubereitungen.

Ganz besonders bevorzugt enthalten kosmetische oder dermatologische Zubereitungen gemäß der Erfindung 0,01–1 Gew.-% an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen oder an wäßrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen aufweisen, bezogen auf die Gesamtzusammensetzung der Zubereitungen.

Die Ascorbylverbindung oder die Ascorbylverbindungen, insbesondere Vitamin C und/oder Derivate wie z. B. Ascor-

bylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat, ist bzw. sind erfindungsgemäß vorteilhaft in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen bevorzugt zu 0,001 Gew.-% bis 10 Gew.-%, bevorzugt zu 0,05 Gew.-% bis 5 Gew.-%, insbesondere bevorzugt zu 0,1-2,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, enthalten.

Die erfindungsgemäßen topischen Zubereitungen können als flüssige, pastöse oder feste Zubereitungen formuliert werden, beispielsweise als wäßrige oder alkoholische Lösungen, wäßrige Suspensionen, Emulsionen, Salben, Cremes, Gele, Öle, Pulver oder Stifte. In Abhängigkeit von der gewünschten Formulierung können Wirkstoffe in pharmazeutische und kosmetische Grundlagen eingearbeitet werden, die als weitere Komponenten beispielsweise Ölkompontenten, Fett und Wachse, Emulgatoren, anionische, kationische, ampholytische, zwittrionische und/oder nichtionogene Tenside, niedere ein- und mehrwertige Alkohole, Wasser, Konservierungsmittel, Puffersubstanzen, Verdickungsmittel, Duftstoffe, Farbstoffe und Trübungsmittel enthalten. Vorteilhaft können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe auch in transdermalen therapeutischen Systemen, insbesondere kubischen Systemen verwendet werden.

Es ist von Vorteil, den pflegenden topischen Zubereitungen Zusatzstoffe wie Vitamine, Coenzyme, Substrate und Hilfsfaktoren des Lipidstoffwechsels oder des Energiestoffwechsels oder sonstige kosmetische oder dermatologische Hilfs- oder Wirkstoffe zuzusetzen, beispielsweise Pyridoxin, Pyridoxal, Pyridoxamin, Uridin, L-Serin, schwache Carbonsäuren, deren pK_s-Wert zwischen 3 und 5,5 liegt (z. B. Milchsäure und Propionsäure), Citronensäure, Pyruvat sowie zelluläre Energieüberträger (z. B. Kreatin, Guanin, Guanosin, Adenin, Adenosin, Nicotin, Nicotinamid, Riboflavin), Coenzyme (z. B. Coenzym Q₁₀, Pantothenäure, Panthanol, Liponsäure), Hilfsfaktoren (z. B. L-Carnitin), Substrate (z. B. Hexosen, Pentosen, Fettsäuren), Taurocholsäure, Lipide (z. B. Ceramide, Cholesterin, Fettsäuren, Sphingosin, Sphingomyelin, Glucocerebroside), Substrate (z. B. Hexosen, Pentosen, Fettsäuren), Glutathion und/oder natürliche Befuchungsfaktoren (z. B. Aminosäuren, Harnstoff, Pyrrolidonsäure, Glycerin).

Es ist auch von Vorteil, den erfindungsgemäßen Zubereitungen Antioxidantien zuzusetzen. Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z. B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z. B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z. B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z. B. α -Carotin, β -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Chlorogensäure und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z. B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z. B. Thiorodoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, γ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z. B. Butioninsulfoximin, Homocysteininsulfoximin, Butioninsulfoxime, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z. B. p.mol bis μ mol/kg), ferner (Metall-)Chelatoren (z. B. α -Hydroxyfettsäuren, Palmittinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), α -Hydroxysäuren (z. B. Citronensäure, Milchsäure, Äpfelsäure), Huminsäure, Gallussäure, Gallusextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTa und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z. B. γ -Linolensäure, Linolensäure, Ölsäure), Tolsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Tocopherole und Derivate (z. B. Vitamin-E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin-A-palmitat) sowie Koniferenylbenzoat des Benzocetazins, Rutinsäure und deren Derivate, α -Glycosylrutin, Ferulasäure, Furfurylidenglycolol, Carnosin, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakarbonsäure, Nordihydroguajarsäure, Trihydroxybenzophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z. B. ZnO, ZnSO₄) Selen und dessen Derivate (z. B. Selenmethionin), Stibene und deren Derivate (z. B. Stibenoxyd, Trans-Stibenoxyd) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe. Günstig sind auch solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen. Vorzugsweise enthalten diese neben den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen zusätzlich mindestens eine UV-A-Filtersubstanz und/oder mindestens eine UV-B-Filtersubstanz und/oder mindestens ein anorganisches Pigment.

Es ist aber auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindungen, solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlichster Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden z. B. in Tagescremes gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet.

Auch stellen UV-Schutzsubstanzen, ebenso wie Antioxidantien und, gewinschenfalls, Konservierungstoffe, einen wirksamen Schutz der Zubereitungen selbst gegen Verderb dar.

Vorteilhaft können erfindungsgemäße Zubereitungen außerdem Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 6,0 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

Enthalten die erfindungsgemäßen Zubereitungen UVB-Filtersubstanzen, können diese öllöslich oder wasserlöslich sein. Erfindungsgemäß vorteilhafte öllösliche UVB-Filter sind z. B.:

- 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher, 3-Benzylidencampher;
- 4-Aminobenzoensäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoensäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoensäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentyl)ester;
- Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthyl)ester;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon; Ester der Benzophenonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzophenonsäure(2-ethylhexyl)ester;
- Derivate des 1,3,5-Triazins, vorzugsweise 2,4,6-Triaminlo-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin.

Die Liste der genannten UVB-Filter, die in Kombination mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen verwendet werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

- Es kann auch von Vorteil sein, erfindungsgemäße Zubereitungen mit UVA-Filtern zu formulieren, die bisher üblicherweise in kosmetischen Zubereitungen enthalten sind. Bei diesen Substanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-*tert*-Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion.

Gegenstand der Erfindung sind also auch die Kombinationen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe, insbesondere in den topischen Zubereitungen, mit Antioxidantien, Stoffen des aeroben zellulären Energiestoffwechsels und/oder UV-Absorbieren, durch die sich z. B. die Stabilität und die Wirkung der Zubereitung verbessern läßt.

- Die vorstehend aufgeführten Beispiele für kombinierbare Wirkstoffe aus den angegebenen Wirkstoffgruppen dienen dazu, die Erfindung zu beschreiben, ohne daß beabsichtigt ist, die Erfindung auf diese Beispiele zu beschränken.

Darüber hinaus können schützende Formulierungsformen angewendet werden, wobei die erfindungsgemäßen Stoffe z. B. in Liposomen, Micellen, Nanosphären usw. aus z. B. hydrierten Amphiphilen, wie z. B. Ceramiden, Fettsäuren, Sphingomyelin und Phospholipiden bzw. in Cyclodextranen eingeschlossen (verkapselt) werden. Weiterer Schutz kann durch die Verwendung von Schutzgas (z. B. N₂, CO₂) bei der Formulierung und die Verwendung gasdichter Verpackungsformen erreicht werden.

Weitere Hilfs- und Zusatzstoffe können wasserbindende Stoffe, Verdicker, Füllstoffe, Parfüm, Farbstoffe, Emulgatoren, Wirkstoffe wie Vitamine, Konservierungsmittel, Wasser und/oder Salze sein.

- Die erfindungsgemäßen Stoffgruppen lassen sich in alle kosmetischen Grundlagen einarbeiten. Grundsätzlich sind allerdings W/O- und O/W- und W/O/W-Emulsionen, Hydrodispersionen und Lipiddispersionen bevorzugt. Besonders vorteilhaft können erfindungsgemäße Kombinationen in Pflegeprodukte wie beispielsweise O/W-Cremes, W/O-Cremes, O/W-Lotionen usw. eingesetzt werden.

Die Lipidphase kann vorteilhaft gewählt werden aus folgender Substanzgruppe:

- Mineralöle, Mineralwachs
- Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl;
- Fette, Wachs und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z. B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettsäuren mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
- Alkylbenzoate;
- Silikonöle wie Dimethylpolysiloxane, Diethylpolysiloxane, Diphenylpolysiloxane sowie Mischformen daraus.

Die Ölphase der Emulsionen, Ozele oder Hydrodispersionen oder Lipiddispersionen im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropylcoleat, n-Butylstearat, n-Hexylstearat, n-Decylcoleat, Isocetylsearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexylstearat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyleoleat, Oleyleucate, Erucyleoleat, Erucyleucate sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z. B. Jojoböl.

Ferner kann die Ölphase der Emulsionen gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachs, der Silikonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Estersäuretriglyceride, namentlich der Triglyceride gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 bis 18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z. B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaböl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachs, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisnonanoat, Isocicosan, 2-Ethylhexylcooleat, C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinäure-triglycerid, Diacetyllythet.

Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat und Isotridecylisnonanoat sowie Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisnonanoat.

Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisnonanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

Die wäßrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls vorteilhaft

- Alkohole, Diöle oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylen- glykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylen glykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte, fer- 5
ner Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propan diol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdio- 10
xid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate, z. B. Hyaluronsäure, Xanthangummi, Hydroxypro- pylmethylcellulose, besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat, der aus der Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carbopole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils ein- 15
zelnen oder in Kombination.

Im technischen Sinne werden unter Gelen verstanden: Relativ formbeständige, leicht verformbare disperse Systeme aus zumindest zwei Komponenten, welche in der Regel aus einem - meist festen - kolloid zerteilten Stoff aus langketti- 20
gen Molekülgruppierungen (z. B. Gelatine, Kieselsäure, Polysaccharide) als Gerüstbildner und einem flüssigen Dispersionsmittel (z. B. Wasser) bestehen. Der kolloidal zerteilte Stoff wird oft als Verdickungs- oder Geliemittel bezeichnet. Er bildet ein räumliches Netzwerk im Dispersionsmittel, wobei einzelne kolloidal vorliegende Partikel über elektrostati- 25
sche Wechselwirkungen miteinander mehr oder weniger fest verknüpft sein können. Das Dispersionsmittel, welches das Netzwerk umgibt, zeichnet sich durch elektrostatische Affinität zum Geliemittel aus, d. h., ein vorwiegend polares (ins- besondere: hydrophiles) Geliemittel geliert vorzugsweise ein polares Dispersionsmittel (insbesondere: Wasser), wohin- 30
gegen ein vorwiegend unpolares Geliemittel vorzugsweise ein unpolares Dispersionsmittel geliert.

Starke elektrostatische Wechselwirkungen, welche beispielsweise in Wasserstoffbrückenbindungen zwischen Geliem- 35
ittel und Dispersionsmittel, aber auch zwischen Dispersionsmittelmolekülen untereinander verwirklicht sind, können zu starker Vernetzung auch des Dispersionsmittels führen. Hydrogele können zu fast 100% aus Wasser bestehen (neben beispielsweise ca. 0,2-1,0% eines Geliemittels) und dabei durchaus feste Konsistenz besitzen. Der Wasseranteil liegt dabei in einähnlichen Strukturelementen vor, so daß Gele daher ihrer Namensherkunft (aus lat. "gelatum" = "Geflorenes") 40
über den alchimistischen Ausdruck "gelatina" (16. Jhdt.) für nhdt. "Gelatine"] durchaus gerecht werden.

Gele gemäß der Erfindung enthalten üblicherweise Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propan- 45
diol, Glycerin und Wasser in Gegenwart eines Verdickungsmittels, das bei ölig-alkoholischen Gelen vorzugsweise Siliciumdioxid oder ein Aluminiumsilikat, bei wäßrig-alkoholischen oder alkoholischen Gelen vorzugsweise ein Poly- acrylat ist.

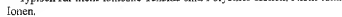
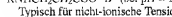
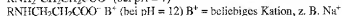
Zubereitungen gemäß der Erfindung können beispielsweise auch als Schaum- und Duschbäder, feste und flüssige Seifen oder sogenannte "Syndets" (synthetische Detergentien), Shampoos, Handwaschpasten, Intimwaschmittel, spezielle 50
Reinigungsmittel für Kleinkinder und dergleichen ausgestaltet werden.

Erfindungsgemäße Zubereitungen können sich gegebenenfalls vorteilhaft durch einen Gehalt an Tensiden auszeich- 55
nen. Tenside sind amphipile Stoffe, die organische, unpolare Substanzen in Wasser lösen können. Sie sorgen, bedingt durch ihren spezifischen Molekülaufbau mit mindestens einem hydrophilen und einem hydrophoben Molekülteil, für eine Herabsetzung der Oberflächenspannung des Wassers, die Benetzung der Haut, die Erleichterung der Schmutzentfer- 60
nung und -lösung, ein leichtes Abspülen und - je nach Wunsch - für Schaumregulierung.

Bei den hydrophilen Anteilen eines Tensidmoleküls handelt es sich meist um polare funktionelle Gruppen, beispiels- 65
weise -COO⁻, -OSO₃⁻, -SO₃⁻, während die hydrophoben Teile in der Regel unpolare Kohlenwasserstoffreste darstellen. Tenside werden im allgemeinen nach Art und Ladung des hydrophilen Molekülteils klassifiziert. Hierbei können vier Gruppen unterschieden werden:

- anionische Tenside,
- kationische Tenside,
- amphotere Tenside und
- nichtionische Tenside.

Anionische Tenside weisen als funktionelle Gruppen in der Regel Carboxylat-, Sulfat- oder Sulfonatgruppen auf. In 70
wäßriger Lösung bilden sie im sauren oder neutralen Milieu negativ geladene organische Ionen. Kationische Tenside sind beinahe ausschließlich durch das Vorhandensein einer quaternären Ammoniumgruppe gekennzeichnet. In wäßriger Lösung bilden sie im sauren oder neutralen Milieu positiv geladene organische Ionen. Amphotere Tenside enthalten so- 75
wohl anionische als auch kationische Gruppen und verhalten sich demnach in wäßriger Lösung je nach pH-Wert wie anionische oder kationische Tenside. Im stark sauren Milieu besitzen sie eine positive und im alkalischen Milieu eine ne- gative Ladung. Im neutralen pH-Bereich hingegen sind sie zwittrionisch, wie das folgende Beispiel verdeutlichen soll:



Typisch für nicht-ionische Tenside sind Polyether-Ketten. Nicht-ionische Tenside bilden in wäßrigem Medium keine 80
Ionen.

A. Anionische Tenside

Vorteilhaft zu verwendende anionische Tenside sind Acylaminosäuren (und deren Salze), wie

1. Acylglutamate, beispielsweise Natriumacylglutamat, Di-TEA-palmitoylaspartat und Natrium Caprylic/Capric 85
Glutamat,

2. Acylpeptide, beispielsweise Palmitoyl-hydrolysiertes Milchprotein, Natrium Cocoylhydrolysiertes Soja Protein und Natrium-/Kalium Cocoylhydrolysiertes Kollagen,
3. Sarcosinate, beispielsweise Myristoyl Sarcosin, TEA-lauroyl Sarcosinat, Natriumlauroylsarcosinat und Natriumcocoylsarcosinat,
4. Taurate, beispielsweise Natriumlauroyltaurat und Natriummethylcocoyltaurat,
5. Acyllactylate, lauroyllactylat, Capryllactylat
6. Alaurinate

Carbonsäuren und Derivate, wie

1. Carbonsäuren, beispielsweise Laurinsäure, Aluminiumstearat, Magnesiumalkanolat und Zinkundecylenat,
2. Ester-Carbonsäuren, beispielsweise Calciumstearoyllactylat, Laureth-6 Citrat und Natrium PEG-4 Lauramidcarboxylat,
3. Ether-Carbonsäuren, beispielsweise Natriumlaureth-13 Carboxylat und Natrium PEG-6 Cocamide Carboxylat

Phosphorsäureester und Salze, wie beispielsweise DEA-Oleth-10-Phosphat und Dilaureth-4 Phosphat, Sulfonsäuren und Salze, wie

1. Acyl-isethionate, z. B. Natrium-/Ammoniumcocoyl-isethionat,
2. Alkylarylsulfonate,
3. Alkylsulfonate, beispielsweise Natriumcocosmonoglyceridsulfat, Natrium C₁₂₋₁₄-Olefin-sulfonat, Natriumlaurylsulfacetat und Magnesium PEG-3 Cocamidulfat,
4. Sulfosuccinate, beispielsweise Dioctylnatriumsulfosuccinat, Dinatriumlaurethsulfosuccinat, Dinatriumlaurylsulfosuccinat und Dinatriumundecylenamido MEA-Sulfosuccinat

sowie

Schwefelsäureester, wie

1. Alkylethersulfat, beispielsweise Natrium-, Ammonium-, Magnesium-, MTPA-, TTPA-Laurethsulfat, Natriummyristeinsulfat und Natrium C₁₂₋₁₃-Parethsulfat,
2. Alkylsulfate, beispielsweise Natrium-, Ammonium- und TEA- Laurylsulfat.

B. Kationische Tenside

Gegebenenfalls vorteilhaft zu verwendende kationische Tenside sind

1. Alkylamine,
2. Alkylimidazole,
3. Ethoxylierte Amine und
4. Quaternäre Tenside,
5. Esterquats.

Quaternäre Tenside enthalten mindestens ein N-Atom, das mit 4 Alkyl- oder Arylgruppen kovalent verbunden ist. Dies führt, unabhängig vom pH Wert, zu einer positiven Ladung. Vorteilhaft sind, Alkylbetain, Alkylamidopropylbetain und Alkyl-amidopropylhydroxysulfain. Die erfindungsgemäß verwendeten kationischen Tenside können ferner bevorzugt gewählt werden aus der Gruppe der quaternären Ammoniumverbindungen, insbesondere Benzyltrialkylammoniumchloride oder -bromide, wie beispielsweise Benzyltrimethylstearylammmoniumchlorid, ferner Alkyltrialkylammoniumsalze, beispielsweise Cetyltrimethylammoniumchlorid oder -bromid, Alkyldimethylhydroxyethylammoniumchloride oder -bromide, Dialkyldimethylammoniumchloride oder -bromide, Alkylamidethyltrimethylammoniumethersulfate, Alkylpyridiniumsalze, beispielsweise Lauryl- oder Cetylpyridiniumchlorid, Imidazolinderivate und Verbindungen mit kationischem Charakter wie Aminoxide, beispielsweise Alkyldimethylaminoxide oder Alkylaminoethyltrimethylaminoxide. Vorteilhaft sind insbesondere Cetyltrimethylammoniumsalze zu verwenden.

C. Amphotere Tenside

Vorteilhaft zu verwendende amphotere Tenside sind

1. Acyl-/dialkylethylendiamin, beispielsweise Natriumacylamphoacetat, Dinatriumacylamphodipropionat, Dinatriumacylamphodiacetat, Natriumacylamphohydroxypropylsulfonat, Dinatriumacylamphodiacetat und Natriumacylamphopropionat,
2. N-Alkylaminosäuren, beispielsweise Aminopropylalkylglutamid, Alkylaminopropionsäure, Natriumalkylimidodipropionat und Lauroamphocarboxyglycinat.

D. Nicht-ionische Tenside

Vorteilhaft zu verwendende nicht-ionische Tenside sind

1. Alkohole,
2. Alkanolamide, wie Cocamide MEA/DEA/MPA,
3. Aminoxide, wie Cocoamidopropylaminoxid,
4. Ester, die durch Veresterung von Carbonsäuren mit Ethylenoxid, Glycerin, Sorbitan oder anderen Alkoholen entstehen,
5. Ether, beispielsweise ethoxylierte/propoxylierte Alkohole, ethoxylierte/propoxylierte Ester, ethoxylierte/propoxylierte Glycerinester, ethoxylierte/propoxylierte Cholesterine, ethoxylierte propoxylierte Triglyceridester, ethoxyliertes propoxyliertes Lanolin, ethoxylierte/propoxylierte Polysiloxane, propoxylierte POE-Ether und Alkylpolyglycoside wie Laurylglucosid, Decylglycosid und Cocoglycosid.
6. Saccharoseester, -Ether
7. Polyglycerinester, Diglycerinester, Monoglycerinester
8. Methylglucosester, Ester von Hydroxysäuren

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen. Mengenangaben, Prozentangaben oder Teile beziehen sich, soweit nicht anders angegeben, auf das Gewicht, insbesondere auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen oder der jeweiligen Mischung.

Beispiel 1

| O/W Crème | | |
|--|-----------|----|
| | Gew.-% | |
| Glycerylstearat | 5,00 | |
| Cetylalkohol | 5,00 | |
| Isopropylpalmitat | 7,00 | 25 |
| Cyclomethicon | 5,00 | |
| Ascorbinsäure | 0,30 | |
| Camellia sinensis (Grünteeextrakt) | 0,30 | |
| NaOH 45%ig | 1,00 | |
| Butylenglycol | 3,00 | 30 |
| Na ₂ H ₂ EDTA | 0,20 | |
| Ethanol | 2,00 | |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. | |
| Wasser | ad 100,00 | 35 |

Die Bestandteile der Ölphase werden miteinander vereinigt, worauf das Gemisch homogenisiert, dann bei 60–70°C mit der ebenfalls vereinigten Wasserphase verührt und homogenisiert wird. Hernach wird auf Raumtemperatur abgekühlt.

Beispiel 2

| O/W Lotion | | |
|--|-----------|----|
| | Gew.-% | |
| Stearoth-20 | 3,00 | |
| Cetylalkohol | 3,00 | |
| Cyclomethicon | 6,00 | |
| Carbomer | 0,60 | |
| Na ₂ H ₂ EDTA | 0,20 | 50 |
| Butylenglycol | 3,00 | |
| NaOH 45%ig | 0,40 | |
| Ascorbinsäure | 0,50 | |
| Camellia sinensis (Grünteeextrakt) | 0,10 | |
| Ethanol | 1,00 | 55 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. | |
| Wasser | ad 100,00 | |

Beispiel 3

| W/O Crème | | |
|-------------------------------------|--------|----|
| | Gew.-% | |
| Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat | 5,00 | 65 |
| Caprylic/Capric Triglyceride | 15,00 | |
| Butylenglycol | 3,00 | |

| | Gew.-% |
|--|-----------|
| Na ₂ H ₂ EDTA | 0,20 |
| MgSO ₄ | 0,70 |
| NaOH 45%ig | 0,32 |
| 5 Ascorbinsäure | 1,00 |
| Camellia sinensis (Grünteeextrakt) | 0,20 |
| Ethanol | 1,00 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

Beispiel 4

O/W-Gel

| | Gew.-% |
|--|-----------|
| Xanthangummi | 2,00 |
| Buylenglycol | 3,00 |
| Na ₂ H ₂ EDTA | 0,20 |
| NaOH 45%ig | 0,32 |
| 20 Ascorbinsäure | 1,00 |
| Camellia sinensis (Grünteeextrakt) | 0,50 |
| Ethanol | 1,00 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

Beispiel 5

O/W-Haarkur

| | Gew.-% |
|--|-----------|
| Bis-Diglycerylpolyacyladipat-2 | 3,00 |
| Behenylalkohol | 4,00 |
| Butylenglycol | 3,00 |
| 35 Cetrimoniumchlorid | 5,00 |
| Citronensäure | 0,50 |
| Na ₂ H ₂ EDTA | 0,20 |
| NaOH 45%ig | 0,16 |
| Ascorbinsäure | 0,50 |
| 40 Camellia sinensis (Grünteeextrakt) | 0,10 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

Patentansprüche

1. Wirkstoffkombinationen aus
 - (a) Extrakten aus Blättern der Pflanzen der Ordnung Theales mit der Familie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia spec.*, ganz besonders der Teesorten *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* bzw. *C. irrawadiensis* und Kreuzungen aus diesen mit beispielsweise *Camellia japonica* und/oder
 - (b) Catechinen und/oder
 - (c) Gallussäureestern von Catechinen und
 - (d) einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere einer oder mehreren wasserlöslichen Ascorbylverbindungen, insbesondere Ascorbinsäure.
2. Verwendung
 - (d) einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere einer oder mehreren wasserlöslichen Ascorbylverbindungen, insbesondere Ascorbinsäure,
 zur Stabilisierung bzw. Verbesserung der Lagerfähigkeit von
 - (a) Extrakten aus Blättern der Pflanzen der Ordnung Theales mit der Familie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia spec.*, ganz besonders der Teesorten *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* bzw. *C. irrawadiensis* und Kreuzungen aus diesen mit beispielsweise *Camellia japonica* und/oder
 - (b) Catechinen und/oder
 - (c) Gallussäureestern von Catechinen.
3. Wirkstoffkombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß das oder die Catechine gewählt wird oder werden aus der Gruppe (-)-Catechin, (+)-Catechin, (-)-Catechin Gallat, (-)-Gallocatechin Gallat, (+)-Epicatechin, (-)-Epicatechin, (-)-Epigallocatechin, (-)-Epigallocatechin Gallat.
4. Wirkstoffkombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß die

Ascorbylverbindung gewählt wird aus der Gruppe Vitamin C und Derivaten wie z. B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat.

5. Wirkstoffkombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2 in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen enthaltend pflanzliche Auszüge mit einem Gehalt an Catechinen, insbesondere solchen Zubereitungen, die Extrakte des grünen Tees enthalten.

6. Wirkstoffkombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2 in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen enthaltend 0,0001-20 Gew.-%, bevorzugt 0,001-10 Gew.-%, insbesondere bevorzugt 0,01-1 Gew.-% an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen oder an wäßrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen aufweisen, vorzugsweise Polyphenole bzw. Catechine aus der Gruppe (-)-Catechin, (+)-Catechin, (-)-Catechingallat, (-)-Gallocatechingallat, (+)-Epicatechin, (-)-Epicatechin, (-)-Epicatechin Gallat, (-)-Epigallocatechin, (-)-Epigallocatechingallat.

7. Wirkstoffkombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2 in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen enthaltend an einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere Ascorbinsäure, 0,001 Gew.-% bis 10 Gew.-%, bevorzugt zu 0,05 Gew.-% bis 5 Gew.-%, insbesondere bevorzugt zu 0,1-2,0 Gew.-%, an einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere Vitamin C und/oder Derivaten wie z. B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

- Leerseite -